

## 改訂版

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局(43)国際公開日  
2005年8月4日 (04.08.2005)

PCT

(10)国際公開番号  
WO 2005/070945 A1(51)国際特許分類<sup>7</sup>: C07H 15/234,  
A61K 31/7036, A61P 31/04

(21)国際出願番号: PCT/JP2005/000767

(22)国際出願日: 2005年1月21日 (21.01.2005)

(25)国際出願の言語: 日本語

(26)国際公開の言語: 日本語

(30)優先権データ:  
特願2004-013642 2004年1月21日 (21.01.2004) JP

(71)出願人(米国を除く全ての指定国について): 明治製菓株式会社 (MEIJI SEIKA KAISHA, LTD.) [JP/JP]; 〒1048002 東京都中央区京橋二丁目4番16号 Tokyo (JP). 財団法人 微生物化学研究会 (MICROBIAL CHEMISTRY RESEARCH FOUNDATION) [JP/JP]; 〒1410021 東京都品川区上大崎三丁目14番23号 Tokyo (JP).

(72)発明者; および

(75)発明者/出願人(米国についてのみ): 箕輪 宣人 (MINOWA, Nobuto) [JP/JP]; 〒2228567 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社内 Kanagawa (JP). 白井 孝之 (USUI, Takayuki) [JP/JP]; 〒2228567 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社内 Kanagawa (JP). 秋山 佳央 (AKIYAMA, Yoshihisa) [JP/JP]; 〒2228567 神奈川県横浜市港北区師岡

町760番地 明治製菓株式会社内 Kanagawa (JP). 平岩 由起子 (HIRAIWA, Yukiko) [JP/JP]; 〒2228567 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社内 Kanagawa (JP). 米田 利夫 (YONEDA, Toshio) [JP/JP]; 〒2228567 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社内 Kanagawa (JP). 長谷川 俊文 (HASEGAWA, Toshifumi) [JP/JP]; 〒2228567 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社内 Kanagawa (JP). 前橋 一紀 (MAEBASHI, Kazunori) [JP/JP]; 〒2228567 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社内 Kanagawa (JP). 井田 孝志 (IDA, Takashi) [JP/JP]; 〒2228567 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社内 Kanagawa (JP). 勝俣 和子 (KATSUMATA, Kazuko) [JP/JP]; 〒2228567 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社内 Kanagawa (JP). 大塚 圭子 (OTSUKA, Keiko) [JP/JP]; 〒2228567 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社内 Kanagawa (JP). 池田 大四郎 (IKEDA, Daishiro) [JP/JP]; 〒1510053 東京都渋谷区代々木5-20-8 Tokyo (JP).

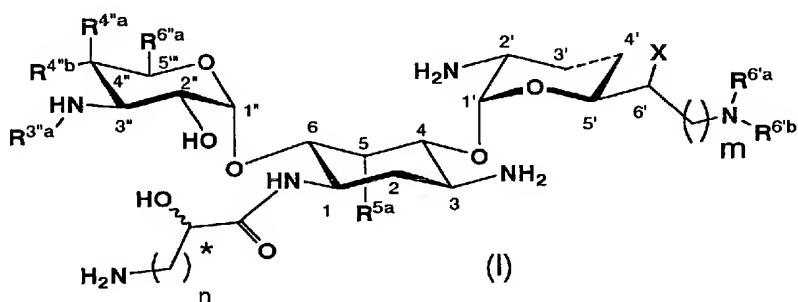
(74)代理人: 吉武 賢次, 外 (YOSHITAKE, Kenji et al.); 〒1000005 東京都千代田区丸の内三丁目2番3号 富士ビル323号 協和特許法律事務所 Tokyo (JP).

(81)指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,

/統葉有/

(54)Title: NOVEL AMINOGLYCOSIDE ANTIBIOTIC EFFECTIVE AGAINST METHICILLIN RESISTANT STAPHYLOCOCCUS AUREUS (MRSA)

(54)発明の名称: メチシリン耐性黄色ブドウ球菌 (MRSA) に有効な新規アミノグリコシド系抗生物質



(57)Abstract: A compound represented by, e.g., the general formula (I) or a pharmacologically acceptable salt or solvate thereof. They have excellent antibacterial activity against bacteria causative of severe infectious diseases such as pneumonia and sepsis, in particular against MRSA. Also provided are: an antibacterial containing any of these compounds; and a medicinal composition containing any of these compounds as an active ingredient.

/統葉有/

WO 2005/070945 A1



ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:  
— 國際調査報告書

(88) 改訂された國際調査報告書の公開日:  
2005年12月15日

(15) 訂正情報:  
PCTガゼットセクションIIのNo.50/2005(2005年12月15日)を参照

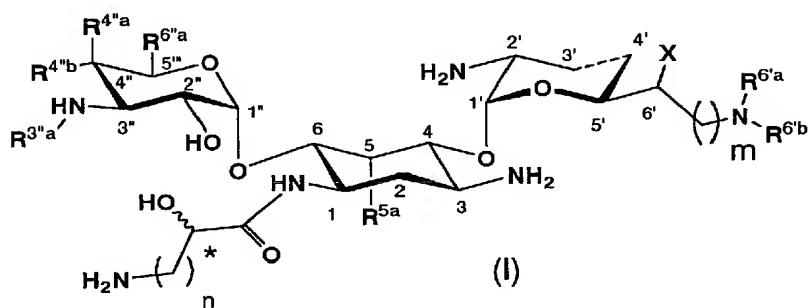
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドノート」を参照。

---

(57) 要約:

肺炎、敗血症等の重症感染症の起因菌、特にMRSAに対して優れた抗菌活性を有する、一般式(I)等で表される化合物またはそれらの薬理学的に許容されうる塩もしくは溶媒和物およびこれらの化合物を含んでなる抗菌剤、並びにこれらの化合物を有効成分とする医薬組成物が開示されている。

【化1】



**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP2005/000767

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
 Int.Cl<sup>7</sup> C07H15/234, A61K31/7036, A61P31/04

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
 Int.Cl<sup>7</sup> C07H15/234, A61K31/7036, A61P31/04

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
 WPI (DIALOG), BIOSIS (DIALOG), CAS (STN)

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	Tetsuo SHITARA et al., "Synthesis of 5-deoxy-5-epifluoro derivatives of arbekacin, amikacin, and 1-N-[(s)-4-amino-2-hydroxybutanoyl]tobramycin", Carbohydrate Research, Vol.276, (1995), pages 75 to 89	1-26
A	Hamao UMEZAWA et al., "Synthesis of 1-N-acyl derivatives of 3',4'-Dideoxy-6'-N-methyl-kanamycin B and their antibacterial activities", J.Antibiotics, Vol.28, (1975), pages 340 to 343	1-26
A	JP 3215759 B2 (Zaidan Hojin Biseibutsu Kagaku Kenkyukai), 27 July, 2001 (27.07.01), & EP 601909 A2 & US 5488038 A	1-26

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	"&" document member of the same patent family
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search  
 29 March, 2005 (29.03.05)

Date of mailing of the international search report  
 12 April, 2005 (12.04.05)

Name and mailing address of the ISA/  
 Japanese Patent Office

Authorized officer

Faxsimile No.

Telephone No.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**International application No.  
PCT/JP2005/000767

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 52-244 A (Scherico Ltd.), 05 January, 1977 (05.01.77), & US 4000261 A & GB 1528930 A	1-26

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**International application No.  
PCT/JP2005/000767**Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.: 27  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:  
The claim involves an invention which is a method for treating humans. This invention is not considered to be an industrially usable one.
2.  Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3.  Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

**Remark on Protest**

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
 No protest accompanied the payment of additional search fees.

## A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int. C17 C07H15/234, A61K31/7036, A61P31/04

## B. 調査を行った分野

## 調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int. C17 C07H15/234, A61K31/7036, A61P31/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

WPI(DIALOG), BIOSIS(DIALOG), CAS(STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	Tetsuo Shitara et al. "Synthesis of 5-deoxy-5-epifluoro derivatives of arbekacin, amikacin, and 1-N-[ (s)-4-amino-2-hydroxybutanoyl]tobramycin" Carbohydrate Research, Vol. 276 (1995) p. 75-89	1-26
A	Hamao Umezawa et al. "Synthesis of 1-N-acyl derivatives of 3', 4'-Dideoxy-6'-N-methyl-kanamycin B and their antibacterial activities" J. Antibiotics, vol. 28 (1975) p. 340-343	1-26
A	JP 3215759 B2 (財団法人微生物化学研究会) 2001.07.27	1-26

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

## の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&amp;」同一パテントファミリー文献

## 国際調査を完了した日

29.03.2005

## 国際調査報告の発送日

12.4.2005

## 国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

## 特許序審査官(権限のある職員)

加藤 浩

4C 9050

電話番号 03-3581-1101 内線 3450

## 国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP2005/000767

C(続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	& EP 601909 A2 & US 5488038 A  JP S52-244 A(シリコ リミテッド)1977.01.05 & US 4000261 A & GB 1528930 A	1-26

## 第II欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見（第1ページの2の続き）

法第8条第3項（PCT第17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1.  請求の範囲 27 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、

同項には、ヒトを治療する方法の発明が含まれており、産業上利用できる発明であるとは認められない。

2.  請求の範囲 は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、

3.  請求の範囲 は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

## 第III欄 発明の単一性が欠如しているときの意見（第1ページの3の続き）

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

1.  出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2.  追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3.  出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4.  出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

## 追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。  
 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。